

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成20年2月14日(2008.2.14)

【公表番号】特表2007-519660(P2007-519660A)

【公表日】平成19年7月19日(2007.7.19)

【年通号数】公開・登録公報2007-027

【出願番号】特願2006-550028(P2006-550028)

【国際特許分類】

C 07 D 451/02 (2006.01)

【F I】

C 07 D 451/02

【手続補正書】

【提出日】平成19年12月13日(2007.12.13)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

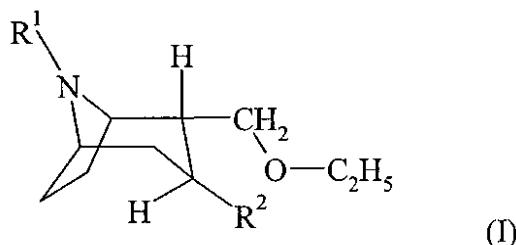
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の2-(エトキシメチル)-トロパン誘導体又は薬剤として許容されるその塩を調製する方法であって、

【化1】



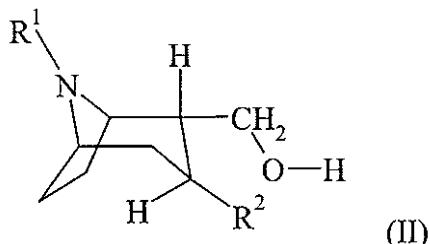
[式中、

R¹は、水素又はC₁~₆アルキルを表し、

R²は、ハロゲン、トリフルオロメチル、又はシアノで場合によって一置換若しくは多置換されたフェニルを表す]

塩基、相間移動触媒、及び場合によって希釀剤の存在下で、式(II)の2-(ヒドロキシメチル)-トロパン誘導体

【化2】



[式中、R¹及びR²は、式(I)について定義した通りである]

を臭化工チルと反応させ、次いで酸で場合によって処理し、

塩基は、水酸化リチウム、水酸化ナトリウム及び水酸化カリウムからなる群から選択されることを特徴とする、上記方法。

【請求項2】

R¹がメチルを表し、

R²が3,4-ジクロロフェニルを表す

請求項1に記載の方法。

【請求項3】

塩基として、粉末の水酸化カリウムを使用することを特徴とする、請求項1又は2に記載の方法。

【請求項4】

相間移動触媒として、テトラアルキルアンモニウム又はテトラアルキルホスホニウム塩を使用することを特徴とする、請求項1から3までの一項に記載の方法。

【請求項5】

相間移動触媒として、硫酸水素テトラアルキルアンモニウムを使用することを特徴とする、請求項4に記載の方法。

【請求項6】

希釈剤として、芳香族炭化水素、場合によってハロゲン化された脂肪族炭化水素、又はエーテルを使用することを特徴とする、請求項1から5までの一項に記載の方法。

【請求項7】

希釈剤として、トルエン、ジクロロメタン、又は1,2-ジメトキシエタンを使用することを特徴とする、請求項6に記載の方法。

【請求項8】

前記反応が-10～+90の範囲の温度で行われることを特徴とする、請求項1から7までの一項に記載の方法。

【請求項9】

5～180分以内に臭化工チルを計量供給し、得られた反応混合物をさらに30～180分間攪拌することを特徴とする、請求項1から8までの一項に記載の方法。

【請求項10】

1当量の式(II)に対して、0.75～100当量の臭化工チルを加えることを特徴とする、請求項1から9までの一項に記載の方法。

【請求項11】

1当量の式(II)に対して、2.5～100当量の塩基を加えることを特徴とする、請求項1から10までの一項に記載の方法。

【請求項12】

1当量の式(II)に対して、0.01～0.5当量の相間移動触媒を加えることを特徴とする、請求項1から11までの一項に記載の方法。

【請求項13】

式(II)の化合物の臭化工チルとの反応が終了した後、この反応混合物に水を添加し、相を分離し、その有機相を水で洗浄し、減圧下で蒸発させ、且つその残渣を、任意のさらなる精製なしで対応する酸で処理することを特徴とする、請求項1から12までの一項に記載の式2(I)の-(エトキシメチル)-トロパン誘導体の塩を調製する方法。